

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization

International Bureau



(43) International publication date

18 December 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) International publication number

WO 03/104303 A1

(51) International patent classification⁷:

C08G 69/10, A61K 47/34, 47/42, 9/51, C08G 69/48

(21) International application number: PCT/FR03/50003

(22) International filing date: 3 June 2003 (03.06.2003)

(25) Language of filing: French

(26) Language of publication: French

(30) Data relating to the priority:

02/07,008 7 June 2002 (07.06.2002) FR

(71) Applicant (for all designated States except US): FLAMEL TECHNOLOGIES [FR/FR]; 33 avenue du Docteur Georges Lévy, F-69200 VENISSIEUX (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (US only): CHAN, You-Ping [FR/FR]; 14 bd Jean XXIII, F-69008 LYON (FR). ANGOT, Stéphanie [FR/FR]; 123 bis cours Albert Thomas, F-69003 LYON (FR). BREYNE, Olivier [FR/FR]; 5 rue Rosset, F-69004 LYON (FR).

(74) Representatives: CABINET PLASSERAUD etc., 84 rue d'Amsterdam, F-75440 PARIS CEDEX 09 (FR).

(81) Designated states (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated states (regional): ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

- With International Search Report.
- Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments.

For an explanation of the two-letter codes and the other abbreviations, reference is made to the explanations ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the beginning of each regular edition of the PCT Gazette.

As printed

(54) Title: POLYAMINOACIDS FUNCTIONALIZED BY ALPHA TOCOPHEROL AND USES THEREOF, PARTICULAR FOR THERAPEUTIC APPLICATIONS

(54) Titre: POLYAMINOACIDES FONCTIONNALISÉS PAR DE L'ALPHA-TOCOPHEROL ET LEURS APPLICATIONS NOTAMMENT THÉRAPEUTIQUES

(57) Abstract: The invention concerns novel biodegradable polyaminoacid materials, useful in particular for vectoring active principle(s). The invention also concerns novel pharmaceutical, cosmetic, dietetic or phytosanitary compositions based on said polyaminoacids. The invention aims at providing a novel polymer raw material, capable of being used for vectoring active principles and enabling optimal fulfillment of all specified requirements: biocompatibility, biodegradability, easy and inexpensive transformation into particles vectoring active principles, said particles being themselves capable of forming colloidal suspensions, of being easily associated with numerous active principles, and of releasing said active principles in vivo. Therefor, the present invention concerns first of all amphiphilic polyaminoacids comprising aspartic acid units and/or glutamic acid units, characterized in that at least part of said units carry grafts including at least one alpha-tocopherol motif, for example (polyglutamate or polyaspartate grafted with alpha-tocopherol of synthetic or natural origin).

(57) Abrégé : La présente invention concerne des nouveaux matériaux à base de polyaminoacides biodégradables, utiles notamment pour la vectorisation de principe(s) actif(s) (PA). L'invention vise aussi de nouvelles compositions pharmaceutiques, cosmétiques diététiques ou phytosanitaires à base de ces polyaminoacides. Le but de l'invention est de fournir une nouvelle matière première polymère, susceptible d'être utilisée pour la vectorisation de PA et permettant de satisfaire de manière optimale à toutes les spécifications du cahier des charges : biocompatibilité, biodégradabilité, aptitude à se transformer aisément et économiquement en particules de vectorisation de principes actifs, ces particules étant elles même propres à former des suspensions colloïdales aqueuses stables, à s'associer facilement avec de nombreux principes actifs, et à libérer ces principes actifs in vivo. Ce but est atteint par la présente invention qui concerne tout d'abord des polyaminoacides amphiphiles comprenant des unités aspartique et/ou des unités glutamiques, caractérisés en ce qu'au moins une partie de ces unités sont porteuses de greffons comportant au moins un motif alpha-tocophérol, e.g. : (polyglutamate ou polyaspartate greffé par l'alpha tocophérol d'origine synthétique ou naturelle).

WO 03/104303 A1

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No
PCT/FR 03/50003

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE CIB 7 C08G69/10 A61K47/34 A61K47/42 A61K9/51 C08G69/48		
Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB		
B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement) CIB 7 C08G A61K		
Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche		
Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés) EPO-Internal		
C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		
Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	EP 0 179 023 A (BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE) 23 avril 1986 (1986-04-23) le document en entier	
A	& US 4 888 398 A (BICHON ET AL) 19 décembre 1989 (1989-12-19) cité dans la demande	
A	WO 87 03891 A (BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE) 2 juillet 1987 (1987-07-02) revendications	
A	US 6 320 017 B1 (ANSELL STEVEN MICHIAL) 20 novembre 2001 (2001-11-20) revendications	
<input type="checkbox"/> Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents <input checked="" type="checkbox"/> Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe		
* Catégories spéciales de documents cités:		
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div style="width: 45%;"> <p>*A* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent</p> <p>*E* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date</p> <p>*L* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)</p> <p>*O* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens</p> <p>*P* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée</p> </div> <div style="width: 45%;"> <p>*T* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention</p> <p>*X* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément</p> <p>*Y* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier</p> <p>*Z* document qui fait partie de la même famille de brevets</p> </div> </div>		
Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée <div style="text-align: center; font-weight: bold;">23 octobre 2003</div>		Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale <div style="text-align: center; font-weight: bold;">30/10/2003</div>
Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale Office Européen des Brevets, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Fonctionnaire autorisé <div style="text-align: center; font-weight: bold;">Leroy, A</div>

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No

PCT/FR 03/50003

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
EP 0179023	A	23-04-1986	AT 60340 T	15-02-1991
			CA 1336034 C	20-06-1995
			DE 3581471 D1	28-02-1991
			EP 0179023 A2	23-04-1986
			JP 1963038 C	25-08-1995
			JP 6089138 B	09-11-1994
			JP 61101533 A	20-05-1986
			US 4976962 A	11-12-1990
			US 4888398 A	19-12-1989
WO 8703891	A	02-07-1987	CH 667874 A5	15-11-1988
			WO 8703891 A1	02-07-1987
			EP 0250492 A1	07-01-1988
			JP 63502037 T	11-08-1988
			US 4892733 A	09-01-1990
US 6320017	B1	20-11-2001	US 2002026027 A1	28-02-2002
			AU 751434 B2	15-08-2002
			AU 1746099 A	19-07-1999
			CA 2315695 A1	08-07-1999
			WO 9933493 A1	08-07-1999
			EP 1041976 A1	11-10-2000
			JP 2001527052 T	25-12-2001